

(54) NOVEL BENZOTHAZOLE AND BENZIMIDAZOLE DERIVATIVES AND ANTI-ULCER DRUG CONTAINING THE SAME DERIVATIVES AS ACTIVE INGREDIENTS

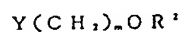
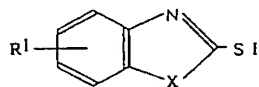
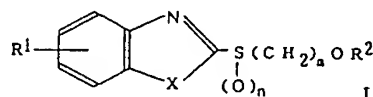
- (11) 2-223562 (A) (43) 5.9.1990 (19) JP
 (21) Appl. No. 64-115184 (22) 10.5.1989 (33) JP (31) 88p.293689 (32) 22.11.1988
 (71) MEIJI SEIKA KAISHA LTD (72) TOMOYA MACHINAMI(8)
 (51) Int. Cl⁵. C07D235/28, A61K31/415, A61K31/425, C07D277/74, C07D277/76

NEW MATERIAL: A compound of formula I [X is S or NH; R¹ is H, lower alkoxy, Cl, Br or I; R² is H, (substituted) lower alkyl, vinyl, aryl or acyl; m and n are 0-2].

EXAMPLE: 5-Chloro-2-[(2-ethoxyethyl)sulfinyl]benzothiazole.

USE: A drug. An active ingredient for anti-ulcer agents. The compound has a strong gastric acid-secreting action and an excellent gastric mucosa-protecting action and is effective for treating and preventing gastric ulcer and duodenal ulcer.

PREPARATION: For example, a compound of formula II is reacted with a compound of formula III (Y is halogen, tosyloxy, mesyloxy, etc.) in a solvent such as N,N-dimethylamide in the presence of NaH, etc., to provide the compound of formula I wherein n is 0. The compound of formula I is reacted with 1-1.2mol equivalent of an oxidizing agent such as H₂O₂ in the presence of a catalyst such as sodium tungstate to provide the compound of formula I wherein n is 1.



(54) OPTICALLY ACTIVE COMPOUND AND USE THEREOF

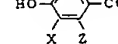
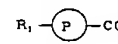
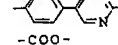
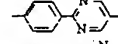
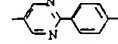
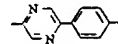
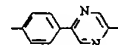
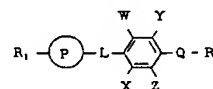
- (11) 2-223563 (A) (43) 5.9.1990 (19) JP
 (21) Appl. No. 64-43080 (22) 27.2.1989
 (71) NIPPON TELEGR & TELEPH CORP <NTT> (72) SHUNGO SUGAWARA
 (51) Int. Cl⁵. C07D239/26, C07D239/28, C07D239/34, C07D241/18, C07D241/24, C09K19/34, C09K19/46, G02F1/137

NEW MATERIAL: An optically active compound expressed by formula I (P is formula V, VI, VII, VIII or IX; at least one of W, X, Y and Z is F or Cl; L is formula X or -OCO-; Q is formula X or -O-; R₁ is ≥4C alkyl, alkyloxy or alkyloxycarbonyl; R₂ is ≥4C alkyl and at least either of R₁ and R₂ is optically active group).

EXAMPLE: 4'-(2-Methylbutyloxycarbonyl)tetrafluorophenyl 5-(4-hexyloxyphenyl)pyrazine-2-carboxylate.

USE: One component of liquid crystal compositions, having great spontaneous polarization and capable of exhibiting a chiral smectic C phase within a wide temperature range and used as an optical switching element.

PREPARATION: A compound expressed by formula II is reacted with a chlorinating agent, such as SOCl₂, to provide a compound expressed by formula III, which is then reacted with a compound expressed by formula IV to afford the compound expressed by formula I (L and Q are formula X).



(54) AMINOPYRIDINE DERIVATIVE, PRODUCTION THEREOF AND INSECTICIDE AND GERMICIDE

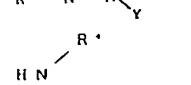
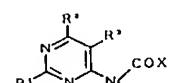
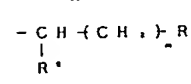
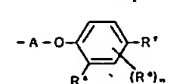
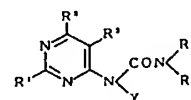
- (11) 2-223564 (A) (43) 5.9.1990 (19) JP
 (21) Appl. No. 64-199208 (22) 2.8.1989 (33) JP (31) 88p.204728 (32) 19.8.1988(1)
 (71) UBE IND LTD (72) TOKIO OBATA(3)
 (51) Int. Cl⁵. C07D239/42, A01N47/36, C07D239/94, C07D403/12, C07D405/12, C07D405/14, C07D413/12, C07D417/12, C07D491/048, C07D495/04

NEW MATERIAL: A compound expressed by formula I [R¹ is H, alkyl, halogen, etc.; R² and R³ are alkyl, halogen or, together with C to which both are linked, may be a 5- or 6-membered ring condensed with the pyridine ring; R⁴ and R⁵ are H, alkyl, formyl, aralkyl, etc., or together with N to which both are linked, may be a 5- or 6-membered ring; Y is formula II or III (A is alkylene; R⁶ and R⁷ are H, alkyl, etc.; n is 1 or 2; R⁷ is H, alkenyl, alkyl, etc.; R⁸ is H or alkyl; m is 4-15; R¹⁰ is alkyl, alkoxy, etc.).

EXAMPLE: 5-Chloro-N-[2-{4-(2-ethoxyethyl)-2-methylphenoxy}ethyl]-N-(imidazol-1-ylcarbonyl)-6-ethyl-4-pyridinamine.

USE: An insecticide and germicide capable of permeating and migrating downward even in application thereof to stems and leaves and controlling nematodes in root parts.

PREPARATION: A compound expressed by formula IV (X is halogen) is reacted with a compound expressed by formula V to afford the compound expressed by formula I.



⑩ 日本国特許庁(JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

平2-223564

⑬ Int. Cl.

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 平成2年(1990)9月5日

C 07 D 239/42
A 01 N 47/36
C 07 D 239/94

Z 6529-4C
E 6779-4H
6529-4C※

審査請求 未請求 請求項の数 3 (全35頁)

⑮ 発明の名称 アミノピリミジン誘導体、その製法及び殺虫・殺菌剤

⑯ 特 願 平1-199208

⑰ 出 願 平1(1989)8月2日

優先権主張 ⑱ 昭63(1988)8月19日 ⑲ 日本(JP) ⑳ 特願 昭63-204728

㉑ 発 明 者 小 畑 登 紀 夫 山口県宇部市大字小串1978番地の5 宇部興産株式会社宇部研究所内

㉒ 発 明 者 藤 井 勝 利 山口県宇部市大字小串1978番地の5 宇部興産株式会社宇部研究所内

㉓ 発 明 者 成 田 勇 山口県宇部市大字小串1978番地の5 宇部興産株式会社宇部研究所内

㉔ 出 願 人 宇部興産株式会社 山口県宇部市西本町1丁目12番32号

㉕ 代 理 人 弁理士 津 国 肇 外1名

最終頁に続く

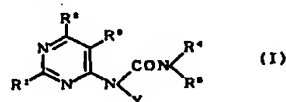
明 細 書

1. 発明の名称

アミノピリミジン誘導体、その製法及び殺虫・殺菌剤

2. 特許請求の範囲

(1) 一般式



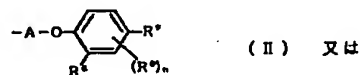
(式中、R¹ は水素原子、C₁~、アルキル基、C₂~、シロクアルキル基又はハロゲン原子を表す。

R² および R³ は同一または異なり、それぞれ C₁~、アルキル基又はハロゲン原子を表すか、或いは R² と R³ はそれらが結合している炭素原子と共に、ピリミジン環に結合する O 又は S 原子で中断されていてもよい飽和又は不飽和の5員又は6員環であってもよく、かつ該環上には1又は2個の低級アルキル基又はハロゲン原子が置換して

いてもよい。

R⁴ および R⁵ は同一又は異なり、それぞれ水素原子、C₁~、アルキル基、ホルミル基、アラールキル基又は置換もしくは非置換のフェニル基を表すか、或いは R⁴ と R⁵ はそれらが結合している炭素原子と共に飽和又は不飽和の5員又は6員環であって、N、O 又は S 原子で中断されていてもよく、かつ該環は炭素環を結合していてもよく、さらに該環上には1又は2個の C₁~、アルキル基、ハロゲン原子、置換もしくは非置換のフェニル基又はフェニルイミノ基が置換していてもよい。

Y は式



を表す。

A は C₂~ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基を表す。

R¹ および R² は同一又は異なって、それぞれ水素原子、C₁~、アルキル基又はハロゲン原子を表す。

n は 1 又は 2 の整数を表す。

R³ は水素原子、C₁~、アルケニル基、1 もしくは 2 個の C₁~、アルキル基が置換していてもよいジオキソラニルメチル基、エトキシイミノアルキル基又は C₁~、アルコキシ、C₁~、アルケニルオキシ、C₁~、アルキニルオキシもしくはベンジルオキシが置換していてもよい C₁~、アルキル基を表す。

R⁴ は水素原子又は C₁~、アルキル基を表す。

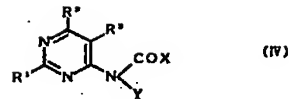
m は 4 ~ 15 の整数を表す。

R⁵ は C₁~、アルキル基、C₁~、アルコキシ基、ハロゲン原子、アセトキシ基又は置換もしくは非置換のフェノキシ基を表す。

で示されるアミノピリミジン誘導体又はその酸付加塩。

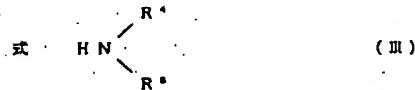
(2)

式



(式中、R¹、R²、R³ 及び Y は請求項 1 で定義された意味を有し、X はハロゲン原子を表す)

で示される化合物を、



(式中、R⁴ 及び R⁵ は請求項 1 で定義された意味を有する)

で示される化合物と反応させることを特徴とする請求項 1 記載の式 (I) で示されるアミノピリミジン誘導体又はその酸付加塩の製法。

(3) 請求項 1 記載の式 (I) で示される化合物を有効成分とする殺虫・殺菌剤。

3

3. 発明の詳細な説明

〔発明の目的〕

〔産業上の利用分野〕

本発明は、アミノピリミジン誘導体、その製法及びそれを有効成分とする殺菌・殺虫剤に関する。

〔従来の技術及び発明が解決しようとする課題〕

従来より、アミノピリミジン誘導体は数多く知られている。例えば、ジャーナル・オブ・アメリカン・ケミカル・ソサエティ (J. A. C. S.) 80, 2189 (1958) には、4-ベンジルアミノ-6-クロルピリミジン及び 4-フリルアミノ-6-クロルピリミジンが利尿剤中間体として開示されているが、これらの化合物については薬薬としての効力は認められなかった。

また、特開昭 54-17123 号公報、特開昭 55-76603 号公報及び特開昭 55-76804 号にはキナゾリン誘導体が、特開昭 59-36666 号公報、特開昭 59-36667 号公報、特開昭 59-42387 号公報、特開昭 61-286373 号公報、及び特開昭 62-67 号公報には種々のピリ

4

ミジン誘導体が開示されている。これらの化合物は、いずれも殺虫、殺ダニ及び殺菌活性を有しており、例えば、コナダ、アブラムシ、ミカンハダニ、ナミハダニ等また稲イモチ病、トマトえき病、トマトべと病、キュウリうどんこ病等農園芸上の各種害虫、ダニ類及び病害に対して有効であることが知られている。

しかしながら、上記公知化合物は、植物に散布した場合、浸透移行性が期待できないため、適用場面が限られていた。更に、園畜動物に対する毒性及び魚毒性の点でも必ずしも満足できるものではなかった。

〔発明の構成〕

〔課題を解決するための手段〕

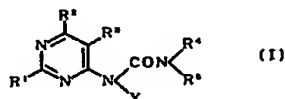
本発明者らは、従来のピリミジン誘導体の問題点を解決すべく鋭意研究の結果、後記一般式で示されるアミノピリミジンの 4 位のアミノ基にカルバモイル基を導入した新規化合物は優れた殺虫、殺ダニ、殺線虫、殺菌効果を示し、とくに茎葉に施用しても下方に浸透移行して根節の線虫を

5

6

防除できるという特徴を有する。また温血動物に対する毒性及び魚毒性も大巾に改善されることを見出した。

本発明は、
一般式



(式中、 R^1 は水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{6-8} シクロアルキル基又はハロゲン原子を表す。

R^2 および R^3 は同一または異なり、それぞれ C_{1-4} アルキル基又はハロゲン原子を表すか、或いは R^2 と R^3 はそれらが結合している炭素原子と共に、ピリミジン環に結合する O 又は S 原子で中断されていてもよい飽和又は不飽和の 5 員又は 6 員環であってもよく、かつ該環上には 1 又は 2 個の低級アルキル基又はハロゲン原子が置換していてもよい。

7

水素原子、 C_{1-4} アルキル基又はハロゲン原子を表す。

n は 1 又は 2 の整数を表す。

R^4 は水素原子、 C_{1-4} アルケニル基、1 もしくは 2 個の C_{1-4} アルキル基が置換していてもよいジオキサニルメチル基、エトキシイミノアルキル基又は C_{1-4} アルコキシ、 C_{6-8} アルケニルオキシ、 C_{6-8} アルキニルオキシもしくはベンジルオキシが置換していてもよい C_{1-10} アルキル基を表す。

R^5 は水素原子又は C_{1-4} アルキル基を表す。

m は 4~15 の整数を表す。

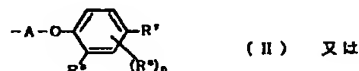
R^{10} は C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、ハロゲン原子、アセトキシ基又は置換もしくは非置換のフェノキシ基を表す。))

で示されるアミノピリミジン誘導体又はその置付加塩。その製造法及びそれを有効成分とする殺虫・殺菌剤を提供するものである。

前記式 (I) において、 C_{1-4} アルキル基とし

R^4 および R^5 は同一又は異なり、それぞれ水素原子、 C_{1-4} アルキル基、ホルミル基、アラルキル基又は置換もしくは非置換のフェニル基を表すか、或いは R^4 と R^5 はそれらが結合している窒素原子と共に飽和又は不飽和の 5 員又は 6 員環であって、N、O 又は S 原子で中断されていてもよく、かつ該環は炭素環を融合していてもよく、さらに該環上には 1 又は 2 個の C_{1-4} アルキル基、ハロゲン原子、置換もしくは非置換のフェニル基又はフェニルイミノ基が置換していてもよい。

Y は式



を表す。

A は C_{2-8} の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基を表す。

R^6 および R^7 は同一又は異なって、それぞれ

8

では、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル及び、tert-ブチルが挙げられる。

C_{6-8} シクロアルキル基としては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等が挙げられる。

ハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。

アラルキル基としては、ベンジル、 α -メチルベンジル、 α -エチルベンジル、フェネチル等が挙げられる。

C_{1-4} アルケニル基としては、ビニル、アリル、1-プロペニル、メタリル等が挙げられる。

C_{1-4} アルコキシ基としては、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシが挙げられる。

C_{6-8} アルケニルオキシ基としては、アリルオキシ、1-プロペニルオキシ、メタリルオキシ等

が挙げられる。

C₃~。アルキニルオキシ基としては、プロパルギルオキシ、1-プロピニルオキシ等が挙げられる。

C₄~。の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基としては、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、1-メチルエチレン、2-メチルエチレン、1-エチルエチレン、2-エチルエチレン、1-メチルプロピレン、2-メチルプロピレン、1-メチルブチレン等が挙げられる。

置換フェニル基又は置換フェノキシ基の置換基としては、1~3個のハロゲン原子、C₁~。アルキル基、C₂~。アルケニル基、C₁~。アルコキシ基、C₂~。アルケニルオキシ基、C₃~。アルキニルオキシ基、トリフルオロメチル基、ニトロ基等が挙げられる。

R^{*}とR^{*}がそれらが結合している炭素原子と共にピリミジン環に結合するO又はS原子で中断されていてもよい飽和又は不飽和の5員又は6員環の例としては、

1 1

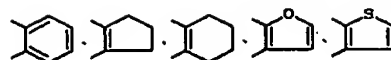
前記式(1)から理解されるように、本発明の化合物はアミノ基を有しており、容易に酸付加塩を形成し、そのような塩もまた本発明に含まれる。酸付加塩を形成する酸は、例えば塩酸、臭化水素酸、硝酸、硫酸、りん酸のような無機酸；ギ酸、しゅう酸、フマル酸、アジピン酸、ステアリン酸、オレイン酸、アコニット酸のようなカルボン酸；メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸のような有機スルホン酸が挙げられる。

前記式(1)で示される化合物のうち、好適なものは次のとおりである。

R^{*}は水素原子が好ましい。

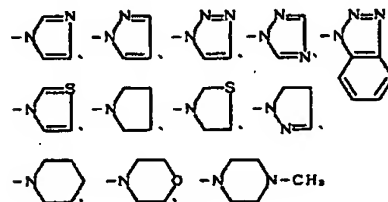
R^{*}およびR^{*}はC₁~。アルキル基である場合は、メチル、エチル、プロピルが好ましく、ハロゲン原子である場合は、塩素および臭素原子が好ましい。

R^{*}がメチル又はエチルであり、R^{*}がメチル、エチル、塩素又は臭素原子であることがとくに好ましい。



等が挙げられる。

R^{*}とR^{*}がそれらが結合している窒素原子と共に飽和又は不飽和の5員又は6員環であって、O、N又はS原子で中断されていてもよい環の例としては、

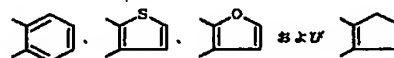


等が挙げられる。

前記式(1)において、いずれかの炭素原子が不斉炭素であるときは、個々の光学異性体、ラセミ化合物又はそれらの混合物も本発明に含まれる。

1 2

R^{*}とR^{*}はそれらが結合している炭素原子と共にピリミジン環に結合するO又はS原子で中断されていてもよい飽和又は不飽和の5員又は6員環を形成する場合は、



の環が好ましく、とくに が好ましい。

R^{*}とR^{*}はそれらが結合している窒素原子と共に飽和又は不飽和の5員又は6員環であって、O、N又はS原子で中断されてもよい環が好ましく、例えばイミダゾール-1-イル、ピラゾール-1-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、2-メチルイミダゾール-1-イル、4-メチルイミダゾール-1-イルおよび2-フェニルイミノ-1,3-チアゾリン-1-イルが好ましい。とくにイミダゾール-1-イルおよびピラゾール-

1 3

1 4

1-イルが好ましい。

Yが式(II)および(III)で示される基を有する化合物で好ましい基は、

R^{*}はメチル、エチルおよびイソプロピルが好ましく、とくにメチルが好ましい

R^{*}は水素原子、1もしくは2個のC₁₋₄アルキル基が置換していてもよいジオキソランニルメチル基、例えば1, 3-ジオキソラン-2-イル-メチル、4-メチル-1, 3-ジオキソラン-2-イル-メチルおよび2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-イル-メチルが好ましく、ならびにC₁₋₁₀アルキル基、例えばメチル、エチル、プロピル、ブチル、ヘキシル、オクチル、ノニルであり、C₁₋₄アルコキシ、C₆₋₁₀アルケニルオキシ、C₆₋₁₀アルキニルオキシもしくはベンジルが置換したエチル基、例えば2-メトキシエチル、2-エトキシエチル、2-プロポキシエチル、2-ブトキシエチル、2-アリルオキシエチル、2-プロパルギルオキシエチルおよび2-ベンジルオキシエチルが好ましい。

R^{*}は水素原子またはメチル基が好ましい。

R^{*}、R^{*}およびR^{*}の置換基において更に好ましい組み合わせは、R^{*}がメチル、R^{*}が2-メトキシエチル、2-エトキシエチル又は2-ベンジルオキシエチルであり、R^{*}が水素原子である。

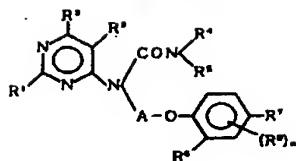
Aはエチレン基が好ましい。

R^{*}は水素原子が好ましい。

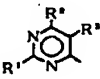



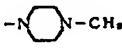

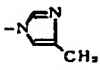




R^{*}はメチル基、メトキシ基又はエトキシ基が好ましい。

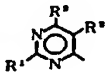








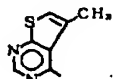




mは5~10、とくに7、8が好ましい。

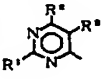

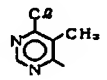

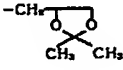
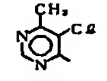
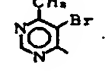

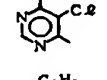
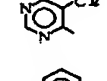

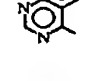

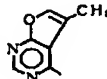


第 1 表

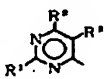




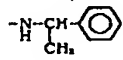
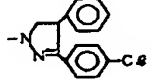



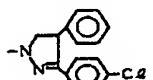

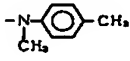
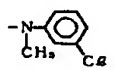


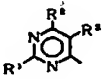


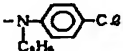

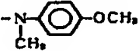








化合物 番号			R ³	R ⁷	(R ⁸) ₂	A	物 性
II-1			CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	(CH ₂) ₆	m.p. 87~88°
II-2	〃		〃	〃	〃	〃	m.p. 67~68°
II-3	〃		〃	〃	〃	〃	m.p. 98~100°
II-4	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ 1.5608
II-5	〃	-NHCH ₃	〃	〃	〃	〃	m.p. 109~111°
II-6	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ 1.5421
II-7	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ 1.5682
II-8	〃		〃	〃	〃	〃	m.p. 63~65°
II-9	〃		〃	〃	〃	〃	m.p. 83~84°

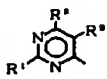

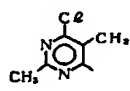



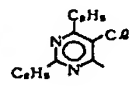


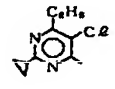


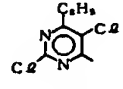




化合物 番 号			R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n	A	物 性
II-10			CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	(CH ₃) ₃	n _D ²⁰ ° 1.5461
II-11	〃		〃	〃	〃	〃	m. p. 91~92°
II-12	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ ° 1.5549
II-13	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ ° 1.5595
II-14	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ ° 1.5758
II-15	〃		i-C ₃ H ₇	H	〃	〃	m. p. 104~106°
II-16	〃	〃	CH ₃	-CH ₂ CH=CH ₂	〃	〃	n _D ²⁰ ° 1.5671
II-17	〃	〃	〃		〃	〃	n _D ²⁰ ° 1.5607
II-18	〃	〃	〃	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	3-CH ₃	〃	m. p. 98~100°
II-19		〃	〃	〃	H	〃	n _D ²⁰ ° 1.5585
II-20	〃	〃	〃	〃	3-CH ₃	〃	n _D ²⁰ ° 1.5622

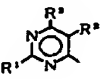







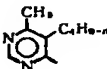



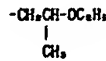
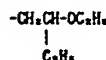

化合物 番 号			R ⁵	R ⁶	(R ⁷) _n	A	物 性
II-21			CH ₃	CH ₃	H	(CH ₃) ₃	n _D ²⁰ 1.5581
II-22	〃	〃	〃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ - 	〃	〃	n _D ²⁰ 1.5787
II-23	〃	〃	i-C ₄ H ₇	H	〃	〃	n _D ²⁰ 1.5626
II-24		〃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OC ₆ H ₅	〃	〃	n _D ²⁰ 1.5514
II-25		〃	〃	〃	〃	〃	m. p. 79~81°
II-26		〃	〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ 1.5868
II-27	〃		〃	〃	〃	〃	m. p. 129~131°
II-28			〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ 1.5841
II-29		〃	i-C ₄ H ₇	H	〃	〃	m. p. 126~128°
II-30		〃	〃	〃	〃	〃	m. p. 85~87°
II-31	〃	〃	CH ₃	-CH ₂ - 	〃	〃	n _D ²⁰ 1.5610

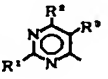






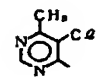



化合物 番 号			R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	A	物 性
II-32			CH ₃		H	(CH ₂) ₂	n _D ²⁰ : 1.5516
II-33		//	//	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅ -n	//	//	n _D ²⁰ : 1.5559
II-34		//	//	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	//	//	n _D ²⁰ : 1.5639
II-35		//	//	//	//	//	n _D ²⁰ : 1.5664
II-36		//	//	//	3-CH ₃	//	n _D ²⁰ : 1.5575
II-37			//	CH ₃	H	//	n _D ²⁰ : 1.5960
II-38			//	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	//	//	n _D ²⁰ : 1.5933
II-39	//	//	//	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	5-CH ₃	//	n _D ²⁰ : 1.5793
II-40	//	//	//	//	3,5-(CH ₃) ₂	//	n _D ²⁰ : 1.5721
II-41		//	//	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ - 	H	//	n _D ²⁰ : 1.5798
II-42		//	//	//	//	//	n _D ²⁰ : 1.6017

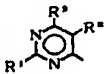














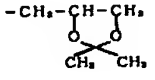
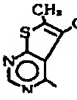
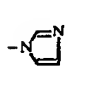


化合物 番 号			R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n	A	物 性
II-43			CH ₃	-n-C ₈ H ₁₇	H	(CH ₂) ₈	n _D ²⁰ 1.5786
II-44	//	//	//	//	//	//	m.p. 114-115°
II-45	//		//	//	//	//	n _D ²⁰ 1.5848
II-46	//		//	//	//	//	m.p. 119-121°
II-47	//		//	//	//	//	m.p. 159-161°
II-48	//		//	H	//	//	n _D ²⁰ 1.5974
II-49	//		//	//	//	//	n _D ²⁰ 1.5924
II-50	//		//	//	//	//	n _D ²⁰ 1.6029
II-51	//		//	//	//	//	m.p. 178-180°
II-52			//	-CH ₂ CH ₂ OC ₁₀ H ₁₉	//	//	n _D ²⁰ 1.5602
II-53	//		//	//	//	//	n _D ²⁰ 1.5650

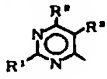

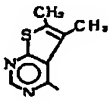














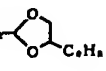

化合物 番 号			R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n	A	物 性
II-54			CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	(CH ₂) ₃	n _D ²⁰ : 1.5604
II-55	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ : 1.5556
II-56	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ : 1.5633
II-57	〃		〃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	〃	〃	n _D ²⁰ : 1.5666
II-58	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ : 1.5670
II-59	〃		〃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ C=CH	〃	〃	n _D ²⁰ : 1.5704
II-60	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ : 1.5661
II-61	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ : 1.5790
II-62	〃		〃	H	〃	〃	n _D ²⁰ : 1.5998
II-63	〃		〃	〃	〃	〃	m. p. 66~68°
II-64	〃		〃	〃	〃	〃	n _D ²⁰ : 1.6154

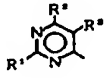



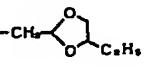


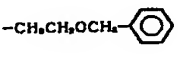


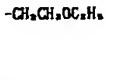
化合物 番 号			R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n	A	物 性
II-65			CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	(CH ₃) _n	
II-66	//		//	//	//	//	
II-67	//		//	//	//	//	
II-68			//	//	//	//	
II-69	//		//	//	//	//	
II-70			//	//	//	//	
II-71	//		//	//	//	//	
II-72			//	//	//	//	
II-73		//	//	//	//	//	n _D ²⁰ 1.5828
II-74	//		//	//	//	//	n _D ²⁰ 1.5874
II-75	//		H	H	//	//	m. p. 87~90°

化合物 番 号			R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n	A	物 性
II-76			H	H	H	{CH ₂ } _n	n _D ²⁰ 1.6096
II-77	"		"	"	"	"	"
II-78			CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	"	"	n _D ²⁰ 1.5371
II-79	"		"	"	"	"	n _D ²⁰ 1.5507
II-80			"	"	"	"	"
II-81		"	"	-CH ₂ CH=NOC ₂ H ₅	"	"	"
II-82		"	"	{CH ₂ } _n OC ₂ H ₅	"	"	n _D ²⁰ 1.5818
II-83	"	"	"		"	"	n _D ²⁰ 1.5873
II-84	"	"	"		"	"	n _D ²⁰ 1.5892
II-85	"	"	"	CH ₃	6-CH ₃		n _D ²⁰ 1.5768
II-86	"	"	"	{CH ₂ } _n CH ₃	H	{CH ₂ } _n	n _D ²⁰ 1.5715

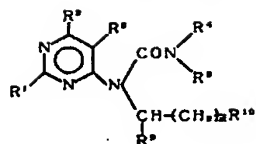
化合物 番 号			R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n	A	物 性
II-87			CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H	(CH ₃) ₂	n _D ²⁰ : 1.5949
II-88	"	"	"	-CH ₂ CH ₂ OC ₆ H ₅ -n	"	"	n _D ²⁰ : 1.5723
II-89	"		CH ₃	"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5795
II-90	"	"	"	-CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	"	"	n _D ²⁰ : 1.6022
II-91	"		"	-C ₆ H ₅ -n	"	(CH ₃) ₂	n _D ²⁰ : 1.5912
II-92	"		"	-CH ₂ CH ₂ OC ₆ H ₅	"	(CH ₃) ₂	n _D ²⁰ : 1.5761
II-93		-NH-C ₆ H ₅ -n	"	"	"	"	m.p. 78~80°
II-94	"	-NH-C ₆ H ₅ -t	"	"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5406
II-95			"	-C ₆ H ₅ -n	"	(CH ₃) ₂	n _D ²⁰ : 1.5893
II-96	"	"	"	-CH ₂ CH ₂ OC ₆ H ₅	6-C ₂	(CH ₃) ₂	n _D ²⁰ : 1.5941
II-97	"		"	"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5863

化合物 番 号			R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	A	物 性
II-98			CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	(CH ₃) ₃	n _D ²⁰ : 1.5513
II-99			//	H	//	//	n _D ²⁰ : 1.5917
II-100			//	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	//	//	m. p. 87~88°
II-101	//	-NH ₂	//	//	//	//	m. p. 150~152°
II-102			1-C ₂ H ₅	H	//	//	n _D ²⁰ : 1.5842
II-103	//		//	//	//	//	n _D ²⁰ : 1.5804
II-104	//		//	//	//	//	m. p. 104~106°
II-105	//		//	//	//	//	n _D ²⁰ : 1.5814
II-106			CH ₃		//	//	n _D ²⁰ : 1.5523
II-107			//	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ - 	//	//	n _D ²⁰ : 1.6068
II-108	//		//	//	//	//	n _D ²⁰ : 1.5992

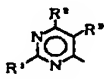




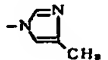








化合物 番 号			R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	A	物 性
II-109			CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ - 	H	(CH ₂) _n	n ⁸ °: 1.5971
II-110			"	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	"	"	n. p. 85~85°
II-111	"		"	"	"	"	n ⁸ °: 1.5936
II-112	"		"	"	3-CH ₃	"	m. p. 109~111°
II-113			"	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ - 	H	"	n ⁸ °: 1.5859
II-114	"		"	"	"	"	m. p. 88~89°
II-115	"		"	"	"	"	n ⁸ °: 1.5734
II-116	"		"	n-C ₂ H ₅	"	"	n ⁸ °: 1.5641
II-117	"		"	"	"	"	n ⁸ °: 1.5596
II-118	"		"	-CH ₂ - 	"	"	n ⁸ °: 1.5547
II-119	"		"	"	"	"	n ⁸ °: 1.5647

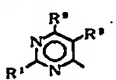








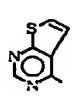








化合物 番 号			R ⁵	R ⁶	(R ⁶) _n	A	物 性
II-120			CH ₃		H	(CH ₃) _n	n _D ²⁰ 1.5524
II-121			//		//	//	m. p. 75~ 76°
II-122	//		//	//	//	//	n _D ²⁰ 1.5750
II-123	//		//		//	//	n _D ²⁰ 1.5580
II-124	化 合 物 番 号 1 の 塩 酸 塩						•-1
II-125	化 合 物 番 号 12 の 塩 酸 塩						•-2
II-126	化 合 物 番 号 1 の し ゅ う 酸 塩						•-3
*-1 元素分析値 C ₂₂ H ₂₂ N ₄ O ₂ ·2HCl として C(%) H(%) N(%) 計算値 51.12 5.46 13.55 実測値 50.87 5.72 13.36							
*-2 元素分析値 C ₂₂ H ₂₂ N ₄ O ₂ ·HCl·H ₂ O として C(%) H(%) N(%) 計算値 53.91 5.90 13.67 実測値 54.10 6.18 13.40							
*-3 元素分析値 C ₂₂ H ₂₂ N ₄ O ₂ ·(COOH) _n として C(%) H(%) N(%) 計算値 53.99 5.29 13.12 実測値 53.62 5.45 12.95							

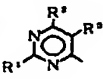












第 1 表

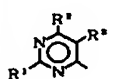










化合物 番 号			R⁶	R¹⁰	m	物 性
III-1			CH₃	CH₃	8	n _D ²⁰ : 1.5153
III-2	"	"	H	"	"	n _D ²⁰ : 1.5190
III-3	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5182
III-4	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5202
III-5	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5180
III-6	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5189
III-7	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5141
III-8	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5166
III-9	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5319

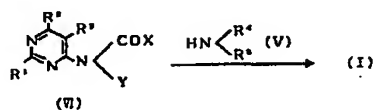
化合物 番号			R ⁷	R ⁸	n	物 性
III-10			H	CH ₃	8	n _D ²⁰ : 1.5225
III-11	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5183
III-12	"		"	"	7	n _D ²⁰ : 1.5186
III-13	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5222
III-14	"		"	"	5	n _D ²⁰ : 1.5237
III-15	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5245
III-16	"		"	"	10	n _D ²⁰ : 1.5139
III-17	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5130
III-18	化合物番号2の  塩					m. p. 77~79°
III-19	化合物番号2の 2 HClO ₄ 塩					-
III-20			H	CH ₃	8	n _D ²⁰ : 1.5220

化合物 番 号			R ⁴	R ⁵	n	物 性
III-21			H	CH ₃	8	n _D ²⁰ 1.5208
III-22	"		"	"	"	n _D ²⁰ 1.5212
III-23			"	"	"	n _D ²⁰ 1.5536
III-24	"		"	"	"	n _D ²⁰ 1.5476
III-25	"		"	"	"	m. p. 70~71°
III-26			"	"	"	m. p. 56~58°
III-27	"		"	"	"	n _D ²⁰ 1.5563
III-28	"		"	"	"	m. p. 105~107°
III-29			"		7	n _D ²⁰ 1.5503
III-30	"		"	"	"	n _D ²⁰ 1.5468
III-31	"		"	"	"	n _D ²⁰ 1.5601

化合物 番 号			R ⁴	R ⁵	n	物 性
III-32			H	CH ₃	5	n _D ²⁰ : 1.5242
III-33	"	"	"	"	10	n _D ²⁰ : 1.5133
III-34	"		"	"	6	n _D ²⁰ : 1.5240
III-35	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5166
III-36	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5248
III-37	"		"	-OCH ₃	"	n _D ²⁰ : 1.5288
III-38	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5260
III-39	"		"	-OC ₂ H ₅	"	n _D ²⁰ : 1.5211
III-40	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5101
III-41	"		"	Cl	8	n _D ²⁰ : 1.5342
III-42	"		"	"	"	n _D ²⁰ : 1.5326

化合物 番 号			R ⁴	R ⁵	n	物 性
III-43			H	-OCH ₃	7	n _D ²⁰ 1.5250
III-44	"		"	"	"	n _D ²⁰ 1.5247
III-45	"		"	-OCOCH ₃	"	n _D ²⁰ 1.5245
III-46	"		"	"	"	n _D ²⁰ 1.5226
III-47	"		"	-OC ₆ H ₅ -n	4	n _D ²⁰ 1.5246
III-48	"		"	"	"	n _D ²⁰ 1.5230

本発明の化合物(I)は、以下に示す方法で製造される。



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および Y は前記と同義であり、 X はハロゲン原子を示す)

前記反応式から明らかなように、本反応では酸が難脱するので、これを捕捉し円滑に反応を行わせるため、塩基の存在下に反応させることが好ましい。

反応は通常、溶媒の存在下で行なわれる。溶媒としては、本反応に関与しないものであれば特に限定はなく、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、メチルナフタレン、石油エーテル、リグロイン、ヘキサン、クロルベンゼン、ジクロルベンゼン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロルエタン、トリクロルエチレン、シクロヘキサンの

ような塩素化されたあるいはされていない芳香族、脂肪族、脂環式の炭化水素類；ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類； N 、 N -ジメチルホルムアミド、 N 、 N -ジメチルアセトアミドのようなアミド類；及び上記溶媒の混合物が挙げられる。

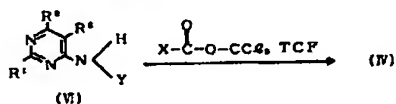
塩基としては、トリエチルアミン、ピリジン、 N 、 N -ジメチルアニリン等の有機塩基、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基が挙げられるが、好ましい塩基は、トリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基である。

さらに、反応速度を上げるため、4- N 、 N -ジメチルアミノピリジン及び4-ピロリジノピリジン等の4- N 、 N -ジアルキルアミノピリジン類を触媒量添加することが好ましい。

3 4

反応温度は特に限定しないが、通常0℃以上で使用する溶媒の沸点以下であるが、5℃ないし室温で反応させることが好ましい。

前記製造法において、原料として用いる式(II)の化合物は以下に示すそれ自体公知の方法により容易に製造することができる。



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 及び Y は前記と同義であり、TCFは、トリクロロメチルハロゲンホーメートの略称である)

本反応では塩酸が難脱するので、これを捕捉し円滑に反応を行わせるため、塩基の存在下に反応させることが好ましい。

反応は通常、溶媒の存在下で行われる。溶媒としては、本反応に関与しないものであれば特に制限はなく、前記の式(IV)と式(V)との反応に用いられる溶媒が使用できる。

3 5

塩基としては、トリエチルアミン、ピリジン、 N 、 N -ジメチルアニリン等の有機塩基が挙げられるが、好ましくは、トリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基である。

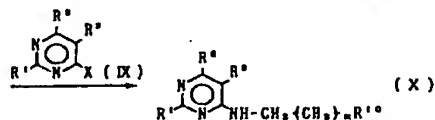
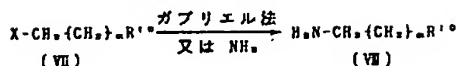
反応温度は特に限定しないが、通常0℃以上で使用する溶媒の沸点以下であるが、5℃以下で反応させることが好ましい。

本反応で得られる式(IV)の化合物は、単離精製することなく、次の式(V)の化合物との反応に用いることもできる。

なお、本製造法において、原料として用いる式(VI)のうち Y が式(II)の化合物は、前述の特許文献、例えば特開昭54-17123号公報、特開昭55-76803号公報、特開昭55-76804号、特開昭59-36666号公報、特開昭59-36667号公報、特開昭59-42387号公報、特開昭61-286373号公報、及び特開昭62-67号公報に記載の方法により容易に製造できる。

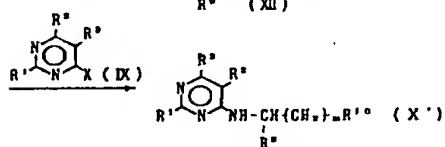
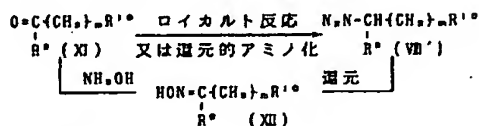
また、式(VI)のうち、 Y が式(III)の化合物は、下記の方法で容易に製造できる。

1. 式 (VI) の化合物のうち、Y が式 (III) において、R^o が水素原子の場合



(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、m 及び X は前記と同様である)

2. 式 (VI) の化合物のうち、Y が式 (III) において、R^o が C₁~4 アルキル基の場合



3 8

シカ類、ヨコバイ類、アブラムシ類、コナジラミ類等；鱗翅目の例えば、ヨトウムシ類、コナガ、ハマキムシ類、メイガ類、モンシロチョウ類等；鞘翅目の例えば、ゾウムシ類、ハムシ類等のほか、ダニ目の例えば、ミカンハダニ、ナミハダニ等の農園害害虫に優れた効果を示す。また、ハエ、カ、ゴキブリ等の衛生害虫にも有効であり、その他許殺害虫にも有効である。

更に、本発明の化合物 (I) は、土壌中の根コブ線虫、マツノザイセンチュウ、ネダニに対しても極めて有効である。特に、根コブ線虫に対しては、土壌処理、茎葉処理のいずれでも優れた効果を示す。従って、本発明で殺虫とは広義の意味で用いられ、狭義の殺虫、殺ダニ、殺線虫等を包含する。

また、本発明の化合物 (I) は、農園害病害にも有効であり、例えば、稲いもち病、大麦うどん粉病のほか、キュウリべと病、トマトえき病等に活性がある。

このように、本発明の化合物の用途、適用場

(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、m 及び X は前記と同様である)

前記の方法によって得られる目的物 (I) は、再結晶、各種クロマトグラフィー等の公知の手段で適宜精製することができる。

融付加塩は、式 (I) の化合物を適当な溶媒、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、メチルナフタレン、石油エーテル、リグロイン、ヘキサン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、トリクロロエチレン、シクロヘキサンのような塩素化された又はされていない芳香族、脂肪族、脂環式の炭化水素類；ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類に溶解し、反応中に酸を導入することによるか、また、反応終了後の反応液に酸を導入することにより容易に得ることができる。

本発明の化合物 (I) は、半翅目の例えば、ウ

3 9

は極めて広範で、効力高く、各種剤型で実用に供することができる。

本発明の殺虫・殺菌剤は、式 (I) の化合物の一種又は数種を有効成分として含有してなる。式 (I) の化合物はそれ自体で用いてもよいが、通常は普通の担体、界面活性剤、分散剤又は補助剤等を配合して、常法により、例えば粉剤、水和剤、乳剤、微粒剤、粒剤、水又は油性懸濁液、エアゾールなどの製剤に調製されて使用される。

好適な担体は、例えばタルク、ベントナイト、クレー、カオリン、ケイソウ土、ホワイターカーボン、パーミキュライト、消石灰、ケイ砂、硫安、尿素等の固体担体；クロシン、鉱油等の炭化水素、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素、クロロホルム、四塩化炭素等の塩素化炭化水素、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン、シクロヘキサノン、イソホロン等のケトン類、酢酸エチル、エチレングリコールアセテート、マレイン酸ジブチル等のエステル類、メタノール、n-ヘキサノール、エチレ

ングリコール等のアルコール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の極性溶媒又は水等の極性担体が挙げられる。また、気体担体としては、空気、窒素、炭酸ガス、フロン等を用い、混合噴射することもできる。

また、本剤の動植物への付着、吸収の向上、薬剤の分散、乳化、展着等の性能の向上を図るための界面活性剤、分散剤としては、例えばアルコール硫酸エステル類、アルキルスルホン酸塩、リグニルスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル等が用いられる。

更に、製剤の性状を改善するために、補助剤として、例えばカルボキシメチルセルロース、ポリエチレングリコール、アラビアゴム等が用いられる。

上記の担体、界面活性剤、分散剤及び補助剤は、それぞれの目的に応じ、各々単独にあるいは組合わせて使用される。

本発明の化合物(1)を製剤化した場合の有効成分濃度は、乳剤では通常1ないし50重量%、

粉剤では通常0.3ないし25重量%、水和剤では通常1ないし90重量%、粒剤では通常0.5ないし5重量%、油剤では通常0.5ないし5重量%、エアゾールでは通常0.1ないし5重量%である。

これらの製剤を適当な濃度に希釈して、植物の茎葉、土壌、水田の水面に散布するか、又は直接施用するなどして、それぞれの目的に応じ、各種用途に供しうる。

(発明の実施例)

以下、実施例により本発明を更に詳細に説明するが、これらの実施例は本発明の範囲を何ら制限するものではない。

参考例1

5-クロロ-N-クロロカルボニル-N-(2-[4-(2-エトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-6-エチル-4-ピリミジンアミンの合成

トリクロロメチルクロロホーマート(TCF) 2.0gをトルエン30mlに溶解し、5℃以下

4 2

に冷却した。この液に攪拌下5-クロロ-N-(2-[4-(2-エトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-6-エチル-4-ピリミジンアミン5.0gとトリエチルアミン1.8gをトルエン20mlに溶解した溶液を滴下し、滴下後室温で3時間攪拌した。反応終了後水20mlを加え、室温で1時間攪拌し、過剰のTCFを分解した。

トルエン層を分取、水洗、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に溶媒を留去し、淡黄色油状液体である目的物6.0gを得た。

実施例1

5-クロロ-N-(2-[4-(2-エトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-N-(イミダゾール-1-イルカルボニル)-6-エチル-4-ピリミジンアミン(化合物番号II-1)の合成

イミダゾール0.4gとトリエチルアミン0.6gをトルエン10mlに溶解し、この液に攪拌下5-クロロ-N-クロロカルボニル-N-

4 3

(2-[4-(2-エトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-6-エチル-4-ピリミジンアミン2.0gをトルエン10mlに溶解した溶液を加え、1時間室温で攪拌した。反応終了後、生成したトリエチルアミン塩酸塩を伊別し少量のトルエンで洗浄した。伊別と洗液を併せて減圧下に溶媒を留去し、得られた淡黄色油状物をカラムクロマトグラフィー(ワコゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=3:1溶出)により単離し、無色結晶である目的物2.0gを得た。m. p. 87~88℃

実施例2

5-クロロ-N-(2-[4-(2-エトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-6-エチル-N-(N'-メチルカルバモイル)-4-ピリミジンアミン(化合物番号II-5)の合成

5-クロロ-N-クロロカルボニル-N-(2-[4-(2-エトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-6-エチル-4-ピリ

ミジニアミン 1.0 g をトルエン 20 ml に溶解し、攪拌下 40% モノメチルアミン水溶液 1 ml を加え、1 時間室温で攪拌した。

反応終了後、トルエン層を分取、水洗、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に溶媒を留去した。得られた結晶をトルエン-*n*-ヘキサンの再結晶し、無色粉末状結晶である目的物 1.0 g を得た。m. p. 109~111℃

実施例 3

5-クロロ-N-(2-[4-(2-エトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-6-エチル-N-(N'-メチル-N'-フェニルカルバモイル)-4-ピリミジンアミン(化合物番号 II-7) の合成

5-クロロ-N-クロロカルボニル-N-(2-[4-(2-エトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-6-エチル-4-ピリミジンアミン 1.0 g をトルエン 20 ml に溶解し、攪拌下 N-メチルアニリン 0.29 g とトリエチルアミン 1 ml 及び触媒量の 4-N,N-ジメ

チルアミノピリジンの混合液を加え、4 時間室温で攪拌した。

反応終了後、生成したトリエチルアミン塩酸塩を伊別し、少量のトルエンで洗浄した。伊液と洗液を併せて減圧下に溶媒を留去し、得られた淡黄色油状物をカラムクロマトグラフィー(ワコーゲル C-200、トルエン:酢酸エチル=3:1 溶出)により単離し、無色油状液体である目的物 0.85 g を得た。n_D²⁰ 1.5682

実施例 4

N-(2-[4-(2-エトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-6-エチル-N-(1,2,4-トリアゾール-1-イルカルボニル)-4-チエノ[2,3-d]ピリミジンアミン(化合物番号 II-27) の合成

イミダゾール 0.4 g とトリエチルアミン 0.6 g をトルエン 20 ml に溶解し、攪拌下 N-クロロカルボニル-N-(2-[4-(2-エトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-4-チエノ[2,3-d]ピリミジンアミン

46

2.25 g をトルエン 10 ml に溶解した溶液を滴下し、室温にて 3 時間攪拌した。

反応終了後、生成したトリエチルアミン塩酸塩を伊別し、少量のトルエンで洗浄した。伊液と洗液を併せて減圧下に溶媒を留去し、得られた淡黄色油状物をカラムクロマトグラフィー(ワコーゲル C-200、トルエン:酢酸エチル=2:1 溶出)により単離し、さらにトルエン-*n*-ヘキサンより再結晶し、無色粉末状結晶である目的物 1.5 g を得た。m. p. 129~131℃

実施例 5

N-(2-[4-(2-メトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-N-(イミダゾール-1-イルカルボニル)-4-キナゾリンアミン(化合物番号 II-38) の合成

トリクロロメチルクロロホーマート 1.0 g をトルエン 20 ml に溶解し、5℃以下に冷却した。この液に攪拌下 N-(2-[4-(2-メトキシエチル)-2-メチルフェノキシ]エチル)-4-キナゾリンアミン 1.68 g とトリエチル

47

アミン 0.9 g をトルエン 10 ml に溶解した溶液を滴下し、滴下後室温で 2 時間攪拌した。次いで、イミダゾール 0.4 g とトリエチルアミン 0.6 g を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応終了後、生成したトリエチルアミン塩酸塩を伊別し、少量のトルエンで洗浄した。伊液と洗液を併せて減圧下に溶媒を留去し、得られた淡黄色油状物をカラムクロマトグラフィー(ワコーゲル C-200、トルエン:酢酸エチル=1:1 溶出)により単離し、無色油状液体である目的物 2.0 g を得た。n_D²⁰ 1.5933

実施例 6

N-(2-(2-メチル-4-*n*-プロピルフェノキシ)エチル)-N-(ピラゾール-1-イルカルボニル)-4-キナゾリンアミン(化合物番号 II-44) の合成

ピラゾール 0.5 g とトリエチルアミン 0.8 g をトルエン 20 ml に溶解し、攪拌下 N-クロロカルボニル-N-[2-(2-メチル-4-*n*-プロピルフェノキシ)エチル]-4-キナゾリ

48

-710-

49

ンアミン 2.7 g をトルエン 10 ml に溶解し、た溶液を滴下し、滴下後室温にて 3 時間攪拌した。

反応終了後、生成したトリエチルアミン塩酸塩を伊別し、少量のトルエンで洗浄した。伊液と洗液を併せて減圧下に溶媒を留去し、得られた結晶をトルエン-*n*-ヘキサンより再結晶し、無色針状結晶である目的物 2.0 g を得た。m. p. 114~115℃

参考例 2

5-クロロ-N-クロロカルボニル-N-*n*-デシル-6-エチル-4-ピリミジンアミンの合成

トリクロロメチルクロロホーメート (TCF) 3.3 g をトルエン 30 ml に溶解し、5℃以下に冷却した液に、攪拌下 5-クロロ-N-*n*-デシル-6-エチル-4-ピリミジンアミン 5.0 g とトリエチルアミン 6.8 g をトルエン 30 ml に溶解した溶液を滴下した。滴下後室温で 5 時間攪拌した。反応終了後、水 20 ml を加え、室温で

30 分攪拌し過剰の TCF を分解した。

トルエン層を分取、水洗、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に溶媒を留去し、淡黄色油状液体である目的物 5.5 g を得た。

実施例 7

5-クロロ-N-*n*-デシル-N-(イミダゾール-1-イルカルボニル)-6-エチル-4-ピリミジンアミン (化合物番号 III-2) の合成

イミダゾール 0.4 g とトリエチルアミン 0.7 g をトルエン 10 ml に溶解した液に、攪拌下 5-クロロ-N-クロロカルボニル-N-*n*-デシル-6-エチル-4-ピリミジンアミン 1.5 g をトルエン 10 ml に溶解した溶液を加え、1 時間室温で攪拌した。反応終了後、生成したトリエチルアミン塩酸塩を伊別し、少量のトルエンで洗浄した。伊液と洗液を併せ、減圧下に溶媒を留去して得られた淡黄色油状物をカラムクロマトグラフィー (ワコーゲル C-200、トルエン：酢酸エチル=3:1 溶出) により単離し、無

50

色油状液体である目的物 1.5 g を得た。

$n_D^{20} = 1.5190$

実施例 8

5-クロロ-N-*n*-デシル-6-エチル-N-(ピラゾール-1-イルカルボニル)-4-ピリミジンアミン (化合物番号 III-3) の合成

ピラゾール 0.4 g とトリエチルアミン 0.7 g をトルエン 10 ml に溶解した液に、攪拌下 5-クロロ-N-クロロカルボニル-N-*n*-デシル-6-エチル-4-ピリミジンアミン 1.5 g をトルエン 10 ml に溶解した溶液を加え、更に触媒量の 4-ジメチルアミノピリジン (DMPA) を添加し、3 時間室温で攪拌した。反応終了後、生成したトリエチルアミン塩酸塩を伊別し、少量のトルエンで洗浄した。伊液と洗液を併せ、減圧下に溶媒を留去して得られた淡黄色油状物をカラムクロマトグラフィー (ワコーゲル C-200、トルエン：酢酸エチル=9:1 溶出) により単離し、無色油状液体である目的物 1.6 g を得た。

52

51

$n_D^{20} = 1.5182$

実施例 9

N-*n*-デシル-N-(イミダゾール-1-イルカルボニル)-4-キナゾリンアミン (化合物番号 III-23) の合成

イミダゾール 0.5 g とトリエチルアミン 0.7 g をトルエン 20 ml に溶解した液に、攪拌下 N-クロロカルボニル-N-*n*-デシル-4-キナゾリンアミン 1.8 g をトルエン 10 ml に溶解した溶液を滴下し、室温で 1 時間攪拌した。反応終了後、生成したトリエチルアミン塩酸塩を伊別し、少量のトルエンで洗浄した。伊液と洗液を併せ、減圧下に溶媒を留去して得られた淡黄色油状物をカラムクロマトグラフィー (ワコーゲル C-200、トルエン：酢酸エチル=3:1 溶出) により単離し、淡黄色油状液体である目的物 1.6 g を得た。

$n_D^{20} = 1.5536$

実施例 10

N-*n*-デシル-N-(2-メチルイミダゾー

ル-1-イルカルボニル}-4-チエノ〔2, 3-d〕ピリミジンアミン(化合物番号Ⅲ-27)の合成

2-メチルイミダゾール0.5gとトリエチルアミン0.7gをトルエン20mlに溶解した液に、攪拌下N-クロロカルボニル-N-n-デシル-4-チエノ〔2, 3-d〕ピリミジンアミン1.8gをトルエン10mlに溶解した溶液を滴下し、更に触媒量の4-ジメチルアミノピリジン(DMPA)を加し、室温で3時間攪拌した。反応終了後、生成したトリエチルアミン塩酸塩を伊別し、少量のトルエンで洗浄した。伊液と洗液を併せ、減圧下に溶媒を留去して得られた淡黄色油状物をカラムクロマトグラフィー(ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=3:1倍出)により単離し、淡黄色油状液体である目的物1.5gを得た。

mp: 1.5563

実施例 11

化合物番号Ⅱ-1の化合物5重量部、ベントナ

イト35重量部、タルク57重量部、ネオベレックスパウダー(商品名：花王アトラス製)1重量部およびリグニンスルホン酸ソーダ2重量部とを均一に混合し、次いで、少量の水を加し混練した後、造粒、乾燥して粒剤を得た。

実施例 12

化合物番号Ⅱ-21の化合物10重量部、カオリン70重量部、ホワイトカーボン18重量部、ネオベレックスパウダー(商品名：花王アトラス製)1.5重量部およびデモール(商品名：花王アトラス製)0.5重量部とを均一に混合し、次いで、粉碎して水和剤を得た。

実施例 13

化合物番号Ⅲ-1の化合物20重量部とキシレン70重量部にトキサノン(商品名：三洋化成工業製)10重量部を加え、均一に混合、溶解して乳剤を得た。

実施例 14

化合物番号Ⅲ-1の化合物5重量部、タルク50重量部およびカオリン45部とを均一に混合して粉剤を得た。

54

実施例 15 コナガに対する効力試験-1

第1表で示した化合物を実施例12に準じて調剤し、界面活性剤(0.01%)を含む水で300ppmとした薬液中で、キャベツ葉片(5cm×5cm)を30秒間浸漬し、プラスチックカップに入れた。風乾後、コナガ3令幼虫を10頭放ち、餌をして、25℃の定温室に放置した。2日後に生死虫数を数え、殺虫率を求め、結果を第2表に示した。

第2表には、殺虫率が100%のものをA、99~80%のものをB、79~60%のものをC、60%以下のものをDとして表示した。

55

第2表

化合物番号	コナガに対する活性
Ⅱ-1	B
12	A
13	B
19	B
20	A
21	A
23	A
26	A
29	A
31	A
32	B
33	B
35	A
36	A
38	A
39	B
40	B
41	B
42	B
43	B
48	B
55	B
57	B
58	B
59	B
73	A
82	A
83	B
92	B
95	A
98	A
106	B
111	B
123	A
124	A
125	A
126	A

56

57

実施例 16 コナガに対する効力試験-2

第1表で示した化合物を実施例12に準じて調剤し、界面活性剤(0.01%)を含む水で1000ppmとした薬液中で、キャベツ葉片(5cm×5cm)を30秒間浸漬し、プラスチックカップに入れた。風乾後、コナガ3令幼虫を10頭放ち、蓋をして、25℃の定温室に放置した。2日後に生死虫数を数え、殺虫率を求め、結果を第3表に示した。

第3表には、殺虫率が100%のものをA、99~80%のものをB、79~60%のものをC、60%以下のものをDとして表示した。

第3表

化合物番号	コナガに対する活性
III-1	A
2	A
3	A
4	A
5	A
6	A
7	A
8	A
9	A
10	A
11	A
12	A
13	A
14	A
15	A
16	A
17	A
18	A
19	A
20	A
21	A
22	A
23	A
24	A
25	A
26	A
27	A
28	A
29	A
30	A
31	A
32	A
33	A
34	A
35	A
36	A
37	A
38	A

58

実施例 17 トビイロウンカに対する効力試験-1

第1表で示した化合物を実施例12に準じて調剤し、界面活性剤(0.01%)を含む水で300ppmとした薬液中で、イネ稚苗を30秒間浸漬し、風乾後、ガラス円筒に差した。トビイロウンカ3令幼虫を10頭放ち、多孔質の栓をして、25℃の定温室に放置した。4日後に生死虫数を数え、殺虫率を求め、結果を第4表に示した。

第4表には、殺虫率が100%のものをA、99~80%のものをB、79~60%のものをC、60%以下のものをDとして表示した。

第4表

化合物番号	トビイロウンカに対する活性
II-1	A
2	B
3	A
4	A
5	A
6	A
7	A
8	A
9	A
10	A
11	A
12	A
13	A
14	A
15	A
16	A
17	A
18	A
19	A
20	A
21	A
22	A
23	A
24	A
25	A
26	A
27	A
28	A
29	A
30	A
31	A
32	A
33	A
34	A
35	A
36	A
37	A
38	A
39	A
40	A
41	A
42	A
43	A
44	A
45	A
46	A
47	A
48	A
49	A
50	A
51	A
52	A
53	A
54	A
55	A
56	A
57	A
58	A
59	A
60	A
61	A
62	A
63	A
64	A
65	A
66	A
67	A
68	A
69	A
70	A
71	A
72	A
73	A
74	A
75	A
76	A
77	A
78	A
79	A
80	A
81	A
82	A
83	A
84	A
85	A
86	A
87	A
88	A
89	A
90	A
91	A
92	A
93	A
94	A
95	A
96	A
97	A
98	A
99	A
100	A
101	A
102	A
103	A
104	A
105	A
106	A
107	A
108	A
109	A
110	A
111	A
112	A
113	A
114	A
115	A
116	A
117	A
118	A
119	A
120	A
121	A
122	A
123	A
124	A
125	A
126	A

60

61

実施例 18 トビイロウンカに対する効力試験

試験-2

第1表で示した化合物を実施例12に準じて調剤し、界面活性剤(0.01%)を含む水で1000ppmとした菌液中で、イネ稚苗を30秒間浸漬し、風乾後、ガラス円筒に差した。トビイロウンカ3令幼虫を10頭放ち、多孔質の栓をして、25℃の定温室に放置した。4日後に生死虫数を数え、殺虫率を求め、結果を第5表に示した。

第5表には、殺虫率が100%のものをA、99~80%のものをB、79~60%のものをC、60%以下のものをDとして表示した。

第5表

化合物番号	トビイロウンカに対する活性
III-2	A
3	A
10	A
13	A
18	A
23	A
25	A
26	A
38	A
39	A
40	A
42	A
44	A
47	A
48	A

実施例 19 ツマグロヨコバイに対する効力試験

第1表で示した化合物を実施例12に準じて調剤し、界面活性剤(0.01%)を含む水で1000ppmとした菌液中で、イネ稚苗を30秒間浸漬し、風乾後ガラス円筒に差した。ツマグロヨコバイ3令幼虫を10頭放ち、多孔質の栓をして、25℃の定温室に放置した。4日後に生死虫

62

数を数え、殺虫率を求めた。

第6表には、殺虫率が100%のものをA、99~80%のものをB、79~60%のものをC、60%以下のものをDとして表示した。

63

第6表-1

化合物番号	ツマグロヨコバイに対する活性
II-12	B
13	B
19	A
21	B
22	B
23	A
24	B
29	A
31	B
32	B
34	B
36	A
38	B
48	B
49	B
56	B
58	A
59	A
60	A
73	B
83	A
84	A
90	A
98	A
102	A
106	A
111	B
123	A
124	A
125	B
126	A

64

65

第6表-2

化合物 号	ツマグロヨコバイに対する活性
III - 2	A
3	A
7	A
8	A
10	A
13	A
14	A
15	A
18	A
19	A
22	A
23	A
25	A
29	A
31	A
34	A
36	A
40	A
44	A
48	A

実施例 20 ナミハダニ雄成虫に対する効力試験

ナミハダニ雄成虫10頭を、インゲン葉片（直径20mm）に供試した。一方、第1表で示した化合物を実施例12に準じて調製し、界面活性剤（0.01%）を含む水で300ppmとした薬液に、葉片を10秒間浸漬した。25℃の定温度に放置し、3日後に生死虫数を数え、殺ダニ率を求めた結果を第7表に示した。

第7表には、殺ダニ率が100%のものをA、99~80%のものをB、79~60%のものをC、60%以下のものをDとして、表示した。

66

第7表

化合物番号	ナミハダニ成虫に対する活性
II - 1	A
2	A
3	A
4	A
12	A
13	A
16	A
17	A
18	A
19	A
20	A
21	A
22	A
23	A
24	A
25	A
26	A
27	A
28	A
29	A
31	A
32	A
33	A
34	A
35	A
36	B
38	A
42	A
43	B
53	B
56	A
57	A
58	A
60	A

68

67

第7表（続き）

化合物番号	ナミハダニ成虫に対する活性
II - 62	A
73	A
74	A
78	A
82	A
83	A
84	A
87	A
88	A
89	A
90	A
91	A
92	A
94	A
95	B
96	A
98	A
106	A
109	B
110	A
111	A
112	A
113	A
114	A
116	A
118	A
119	A
120	A
121	A
122	A
123	A
124	A
125	A
126	A

69

第8表

実施例21 ナミハダニ雄成虫に対する効力試験

ナミハダニ雄成虫10頭を、インゲン葉片(直径20mm)に供試した。一方、第1表で示した化合物を実施例12に準じて調剤し、界面活性剤(0.01%)を含む水で1000ppmとした薬液に、葉片を10秒間浸漬した。25℃の恒温室に放置し、3日後に生死虫数を数え、殺ダニ率を求めた結果を第8表に示した。

第8表には、殺ダニ率が100%のものをA、99~80%のものをB、79~60%のものをC、60%以下のものをDとして、表示した。

化合物番号	ナミハダニ成虫に対する活性
III - 2	A
3	A
4	A
5	A
6	A
7	A
8	A
10	A
11	A
12	A
13	A
14	A
15	A
16	A
17	A
18	A
19	A
21	A
22	A
23	A
25	A
26	A
27	A
29	A
34	A
35	A
36	A
37	A
38	A
39	A
40	A
41	A
42	A
43	A
44	A
48	A

70

実施例22 サツマイモノコブセンチュウに対する効力試験(1)

第1表で示した化合物を実施例12に準じて調剤し、水で希釈し、20ppmの薬液とした。うち、0.5mlを試験管にとり、さらに、サツマイモノコブセンチュウを30頭から40頭含む液0.5mlを加えた。25℃の恒温室に放置し、2日後に顕微鏡下で生死数を数え、殺線虫率を求め結果を第9表に示した。

第9表には、殺線虫率が100%~90%のものをA、89%~80%のものをB、79~60%のものをC、60%以下のものをDとして、表示した。

71

第9表-1

化合物番号	サツマイモノコブセンチュウに対する活性
II - 1	A
2	B
3	A
4	A
12	A
13	A
16	A
17	A
19	A
22	B
24	A
25	A
26	A
27	A
28	A
31	B
32	A
33	A
34	B
35	A
36	A
39	B
41	B
43	B
45	A
56	A
57	A
59	B
73	B
78	B
82	A
84	A
87	B
88	A
92	A
95	B
97	A
98	A
110	B
111	B
116	B
124	B
125	A
126	A

72

-716-

73

第9表-2

化合物 号	サツマイモネコブセンチュウ に対する活性
III - 2	A
5	A
6	A
10	A
11	A
12	A
14	A
18	A
19	A
24	A
26	A
27	A
34	A
35	A
38	A
41	A
43	A

ツマイモネコブセンチュウを接種、さらに、線虫
接種後10日目にゴール数を調べ、結果を第10
表に示した。

第10表には、処理区のゴール数と無処理区の
ゴール数の比較から、防除価が90%以上のもの
をA、89~70%のものをB、69~50%の
ものをC、50%以下のものをDとして表示し
た。

実施例23 サツマイモネコブセンチュウに対す る効果(2)

第1表に示した化合物を実施例12に準じて調
剤し、界面活性剤(0.03%)を含む水で希釈
し、3000ppmの画液とした。画液は本薬が
2葉展開したポット植えのキュウリに充分量を散
布した。散布4日目にポット当たり約500頭のサ

74

75

第10表-1

化合物番号	サツマイモネコブセンチュウ に対する活性
II - 1	A
13	B
19	A
24	A
28	A
33	B
34	A
35	A
38	B
56	B
57	A
59	B
73	A
78	B
82	A
84	B
87	B
88	B
92	A
98	A
111	B
124	A
125	A
126	A

第10表-2

化合物番号	サツマイモネコブセンチュウ に対する活性
III - 2	A
18	A
19	A

76

第1頁の続き

⑥Int. Cl.⁸

識別記号

庁内整理番号

C 07 D 403/12
 405/12
 405/14
 413/12
 417/12
 491/048
 495/04

105 Z

6742-4C
 6742-4C
 6742-4C
 6742-4C
 6742-4C
 8413-4C
 7431-4C

優先権主張 ②昭63(1988)11月30日③日本(JP)④特願 昭63-300996

⑦発明者 敷田 庄司 山口県宇部市大字小串1978番地の5 宇部興産株式会社宇部研究所内

手続補正書

平成 1年 8月28日

特許庁長官 吉田 文 殿

1. 事件の表示

平成1年特許願第199208号

2. 発明の名称

アミノピリミジン誘導体、その製法及び殺虫・殺菌剤

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

名称 (020) 宇部興産株式会社

4. 代理人

住所 〒107 東京都港区赤坂2-10-8 第一信和ビル

氏名 井蓮士 (78661) 特許 電話 (586) 1738~9

5. 補正命令の日付 自 発

6. 補正の対象 明細書の発明の詳細な説明の欄

7. 補正の内容

発明の詳細な説明の欄

(1) 明細書19頁化合物番号Ⅱ-31及び20
 頁化合物番号Ⅱ-32の



と訂正する。



手続補正書

平成 1年 9月 26日

特許庁長官 吉田 文 殿

1. 事件の表示

平成 1年特許願第 189208 号

2. 発明の名称

アミノピリミジン誘導体、その製法及び殺虫・殺菌剤

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

名称 (020) 宇都興産株式会社

4. 代理人

住所 〒107 東京都港区赤坂 2-10-8 第一信和ビル

氏名 弁護士 (7866) 津 国 隆 電話 (586)1738~9

5. 補正命令の日付 自 発

6. 補正の対象 明細書の発明の詳細な説明の欄

7. 補正の内容

方式
審査



手続補正書

平成 1年 10月 11日

特許庁長官 吉田 文 殿

1. 事件の表示

平成 1年特許願第 189208 号

2. 発明の名称

アミノピリミジン誘導体、その製法及び殺虫・殺菌剤

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

名称 (020) 宇都興産株式会社

4. 代理人

住所 〒107 東京都港区赤坂 2-10-8 第一信和ビル

氏名 弁護士 (7866) 津 国 隆 電話 (586)1738~9

5. 補正命令の日付 自 発

6. 補正の対象 明細書の発明の詳細な説明の欄

7. 補正の内容

方式
審査

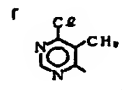


平成 1年 8月 28日提出の手続補正書 2 頁を、次の書面に差し替える。

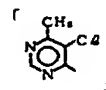
「発明の詳細な説明の欄

(1) 明細書 19 頁化合物 号 II-31 及び 20

頁化合物番号 II-32 の



を



と訂正する。

2

発明の詳細な説明の欄

1) 明細書 43 頁下から 4 行の「6-エチル」を「6-メチル」と訂正する。

2) 同 44 頁 3 行及び下から 5 行の「6-エチル」を「6-メチル」と訂正する。

3) 同 46 頁 2 行、下から 6 行及び末行の「6-エチル」を「6-メチル」と訂正する。

4) 同 46 頁 12 行及び 17 行の「6-エチル」を「6-メチル」と訂正する。